

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

THIS PAGE BLANK (USPTO)

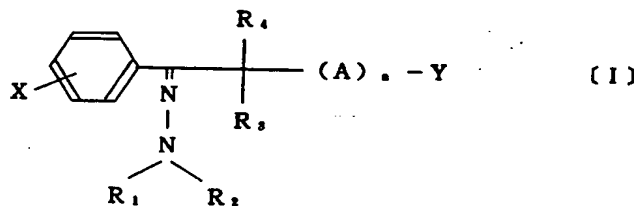


特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 5 C07C 251/86, 323/48, 317/32 C07C 309/65, 251/88, 281/04 C07C 281/10, C07D 213/42, 213/61 C07D 295/22, 249/14 A01N 33/26, 47/24		A1	(11) 国際公開番号 WO 94/11340
			(43) 国際公開日 1994年5月26日 (26.05.94)
(21) 国際出願番号 PCT/JP93/01648 (22) 国際出願日 1993年11月11日 (11. 11. 93)		(81) 指定国 AT, AU, BB, BF (OAPI特許), BG, BJ (OAPI特許), BR, CA, CF (OAPI特許), CG (OAPI特許), CH, CI (OAPI特許), CM (OAPI特許), CZ, DE, DK, ES, FI, GA (OAPI特許), GB, GN (OAPI特許), HU, KR, LK, LU, MG, ML (OAPI特許), MN, MR (OAPI特許), MW, NE (OAPI特許), NL, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SK, SN (OAPI特許), TD (OAPI特許), TG (OAPI特許), UA, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(30) 優先権データ 特願平4/328828 1992年11月13日 (13. 11. 92) JP		添付公開書類 国際調査報告書	
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日本曹達株式会社 (NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP] 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 岸本 孝 (KISHIMOTO, Takashi) [JP/JP] 松田達彦 (MATSUDA, Michihiko) [JP/JP] 波多野達平 (HATANO, Renpei) [JP/JP]. 満井 順 (MITSUI, Jun) [JP/JP] 〒250-02 神奈川県小田原市高田字柳町345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP) 矢野真樹郎 (YANO, Makio) [JP/JP] 〒421-04 静岡県榛原郡榛原町坂部62-1 日本曹達株式会社 榛原農業研究所内 Shizuoka, (JP) (74) 代理人 弁理士 東海裕作, 外 (TOKAI, Yusaku et al.) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)			

(54) Title : HYDRAZONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 ヒドラゾン誘導体

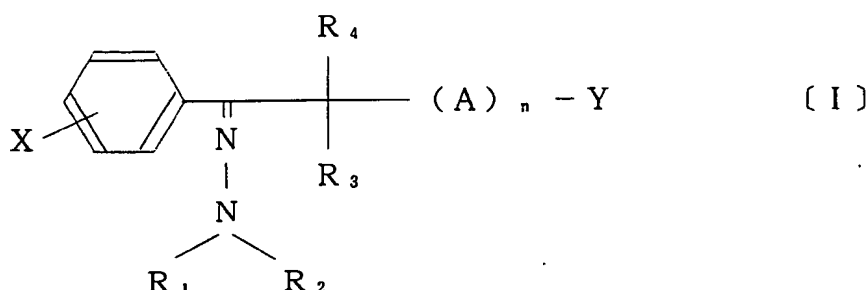


(57) Abstract

A compound represented by general formula (I), a salt thereof, and a pest control agent, wherein: X represents halogen, alkyl, alkoxy, cycloalkyloxy, alkylsulfonyloxy, alkylthio or alkylsulfonyl; R₁ represents hydrogen or alkyl; R₂ represents hydrogen, alkyl, alkylcarbonyl, alkylcarbamoyl, alkoxy carbonyl, phenylcarbonyl or phenylcarbamoyl; or alternatively, R₁ and R₂ may be combined together to form =C(r₁)N_r2r₃, or NR₁R₂ may form a heterocycle; R₃ represents hydrogen or alkyl; R₄ represents alkyl, alkenyl or alkynyl; A represents S, O, alkylene, alkylidene, carbonyl or Nr₄; n represents 0 or 1; and Y represents phenyl or pyridyl.

(57) 要約

本発明は一般式〔I〕



〔式中、Xはハロゲン、アルキル基、アルコキシ基、シクロアルキルオキシ基、アルキルスルフォニルオキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフォニル基、

R₁ は水素原子、アルキル基を、

R₂ は水素原子、アルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルカルバモイル基、アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、フェニルカルバモイル基を、

またR₁ とR₂ が一緒になって、=C (r₁) N r₂ r₃ を形成してもよく、

さらに、NR₁ R₂ が複素環基を形成してもよく、

R₃ は水素原子、アルキル基を、

R₄ はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基を、

AはS、O、アルキレン、アルキリデン、カルボニル、N r₄ を、

nは0、1を、

Yはフェニル基、ピリジル基を表す。〕

で表される化合物またはその塩、有害生物防除剤である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT	オーストリア	DE	ドイツ	KR	大韓民国	PL	ポーランド
AU	オーストラリア	DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル
BB	バルバドス	ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア
BE	ベルギー	FI	フィンランド	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
BF	ブルキナファソ	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SD	スーダン
BG	ブルガリア	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SE	スウェーデン
BJ	ベナン	GB	イギリス	MC	モナコ	SI	スロヴェニア
BR	ブラジル	GE	ジョージア	MD	モルドバ	SK	スロヴァキア共和国
BY	ベラルーシ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	SN	セネガル
CA	カナダ	GR	ギリシャ	ML	マリ	TD	チャド
CF	中央アフリカ共和国	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TG	トーゴ
CG	コンゴ	IE	アイルランド	MR	モリタニア	TJ	タジキスタン
CH	スイス	IT	イタリア	MW	マラウイ	TT	トリニダードトバゴ
CI	コートジボアール	JP	日本	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CN	中国	KE	ケニア	NL	オランダ	US	米国
CS	チェコスロヴァキア	KG	キルギスタン	NO	ノルウェー	UZ	ウズベキスタン共和国
CZ	チェコ共和国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド	VN	ヴェトナム

明 細 書

ヒドラゾン誘導体

技術分野：

本発明は、新規なヒドラゾン誘導体及び有害生物防除剤に関する。

背景技術：

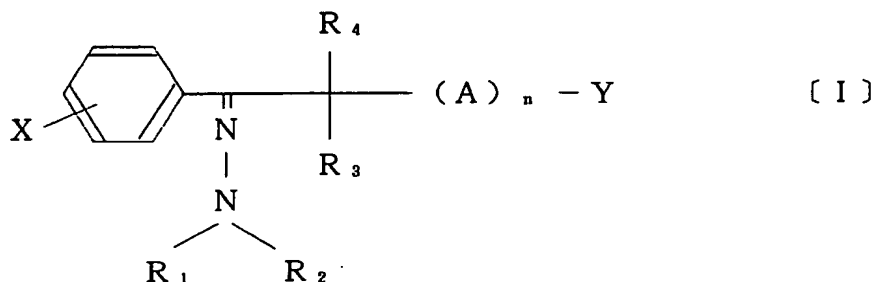
多年にわたる殺虫剤の研究開発によって多くの薬剤、例えばパラチオン、馬拉ソン等の有機リン系殺虫剤、カルバリル、メソミル等のカーバメート系殺虫剤などが開発され実用化されて来た。これら殺虫剤が農業の生産向上に果たした役割は極めて大きいが近年、これらの殺虫剤の中には残留、蓄積環境汚染等の問題から使用が規制されたり、長期使用の結果として抵抗性害虫を発生せしめたものが出て来ている。従って、これら抵抗性害虫をはじめ各種害虫に卓越した殺虫特性を有し、安全に使用できる新規薬剤の開発が要望されている。

本発明化合物と類似の化合物を開示したものとしてEP 500111が知られているが殺ダニ活性は必ずしも十分であるとは言えない。

本発明の目的は工業的に有利に合成でき、効果が確実で安全に使用できる農薬を提供することである。

発明の開示：

本発明は一般式〔I〕



〔式中、Xはハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されてい

もよいアルコキシ基、置換されていてもよいシクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいアルキルスルフォニルオキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基または置換されていてもよいアルキルスルフォニル基を表し、

R_1 は水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表し、

R_2 は水素原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルキルカルボニル基、置換されていてもよいアルキルカルバモイル基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニルカルボニル基または置換されていてもよいフェニルカルバモイル基を表し、

また R_1 と R_2 が一緒になって、 $=C(r_1)Nr_2r_3$ (式中、 r_1 、 r_2 、 r_3 は同一または相異なって水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表す。) を形成してもよく、

さらに、 NR_1R_2 は一緒になって置換されていてもよいNを含む5～7員環の複素環基を形成してもよく(但し R_1 、 R_2 はさらに1～2個の窒素原子または酸素原子を含んでもよい)、

R_3 は水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表し、

R_4 は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を表し、

Aは硫黄原子、酸素原子、置換されていてもよいアルキレン、置換されていてもよいアルキリデン、カルボニルまたは NR_4 (式中、 r_4 は水素原子または置換されていてもよいアルキルを表す。) を表し、

nは0または1を表し、

Yは置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいピリジル基を表す。]

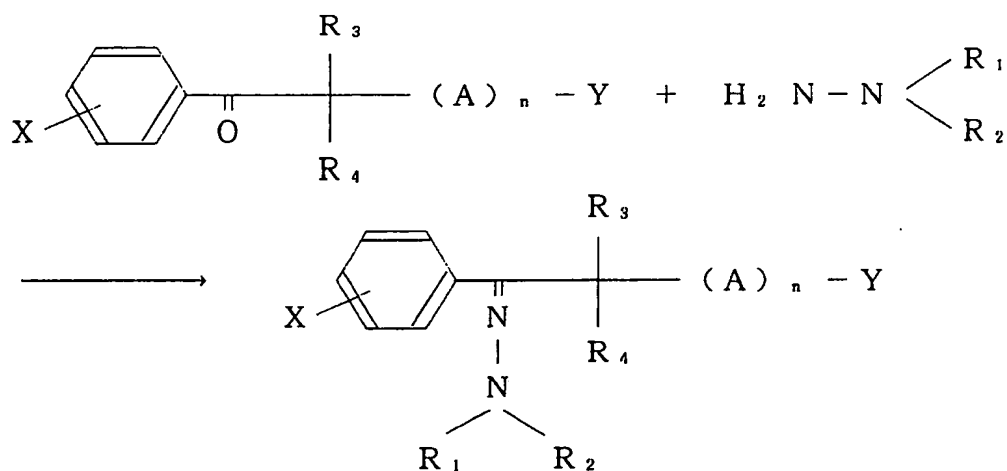
で表される化合物またはその塩及び有害生物防除剤である。

本発明において、アルキル、アルコシキを置換する基としては、例えばハロゲン原子などが挙げられる。フェニルを置換する基としては、例えばハロゲン原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキルオキシなどが挙げられる。複素環基を置換する基としては例えばアルキルなどが挙げられる。ピリジル基を置換する基としては、例えばハロゲン原子などが挙げられ

る。また通常、アルキル、アルコキシの炭素数は1～6であり、シクロアルキルの炭素数は3～8であり、アルケニル、アルキニルの炭素数は2～6である。

本発明の化合物の製造方法は、次の通りである。

製造方法 1

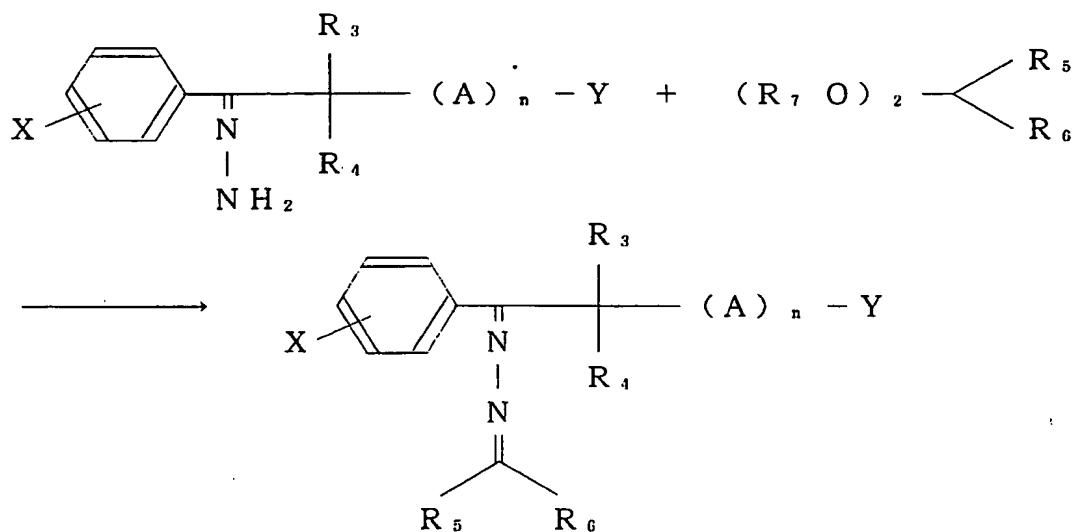


X、R₁、R₂、R₃、R₄、A、n、Yは前記と同じ意味を示す。

反応は所望により有機溶媒中、所望により酸触媒存在下、0℃から200℃、溶媒を用いる場合にはその溶媒の沸点までで、1時間から数10時間行われる。溶媒としては、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類等が使用できる。

酸触媒としては、硫酸、塩酸、パラトルエンスルホン酸等が使用できる。

製造方法 2



上記反応式において R_5 、 R_6 は同一もしくは異なって、水素原子、置換されていてもよいアルキル基、 R_7 は置換されていてもよいアルキル基を示し、 X 、 R_3 、 R_4 、 A 、 n 、 Y は前記と同じ意味を示す。

反応は所望により有機溶媒中、 0°C から 200°C 、溶媒を用いる場合にはその溶媒の沸点までで、1時間から数10時間行われる。

溶媒としては、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類等が使用できる。

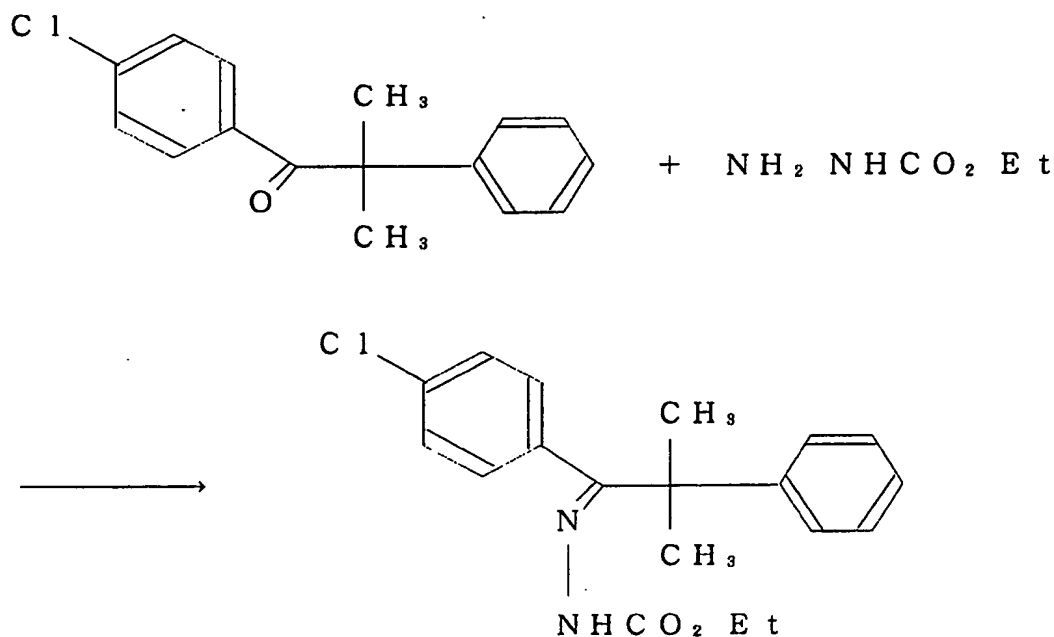
反応終了後は通常の後処理を行うことにより目的物を得ることができる。

本発明化合物の構造は、IR、NMR、MS等から決定した。

発明を実施するための最良の形態：

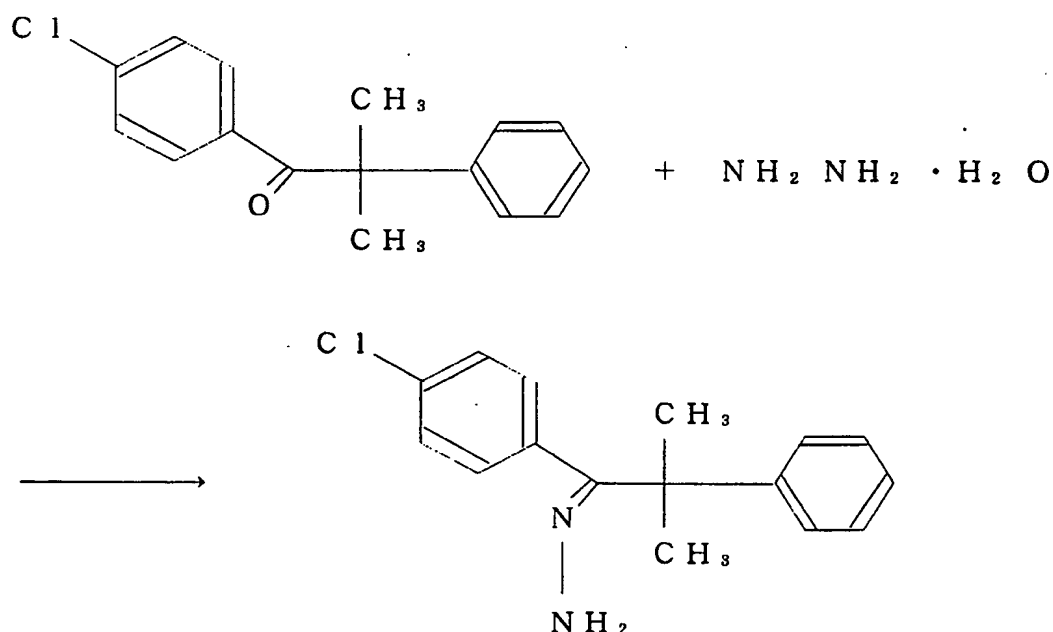
次に実施例を挙げ、本発明を更に詳しく説明する。

実施例1：4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン エトキシカルボニルヒドラゾン（化合物番号4）



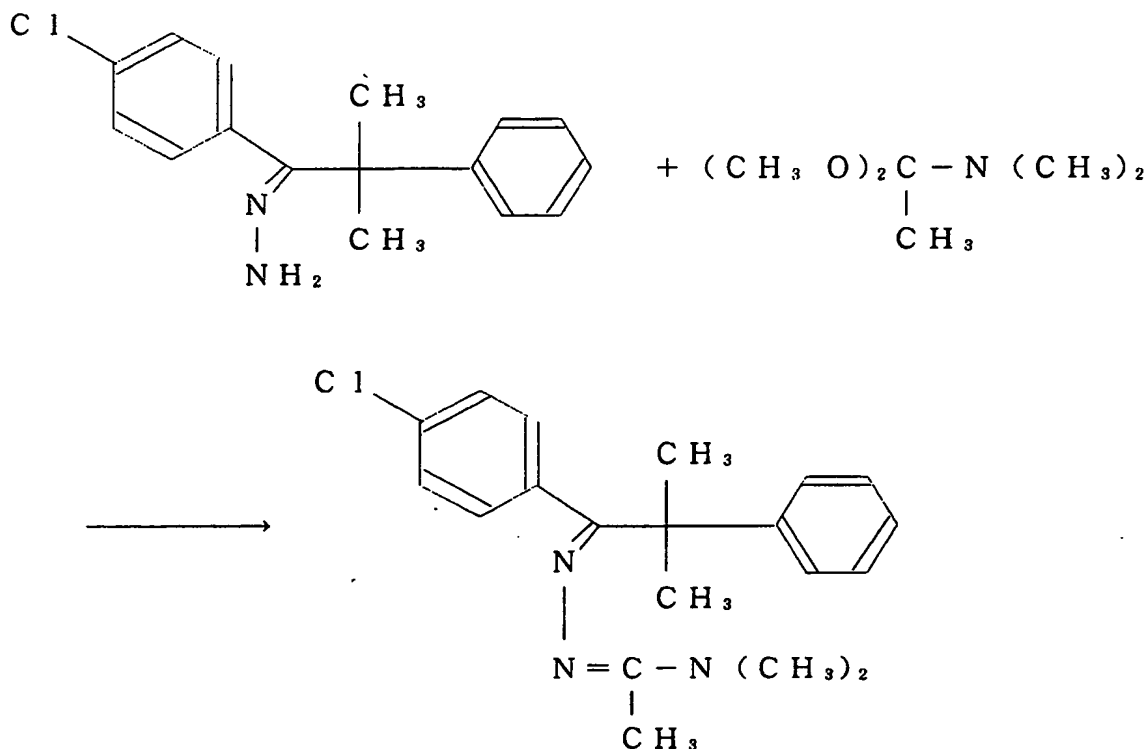
0.8 g の 4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノンに、0.4 g のエチルカーバゼート、及び触媒量のパラトルエンスルホン酸を加え、120℃で5時間攪拌した。反応終了後、混合物を室温にまで冷却し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより分離精製して、目的物である白色結晶の 4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン エトキシカルボニルヒドラゾン 0.8 g を得た。mp 123-124℃

実施例 2：4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノンヒドラゾン（化合物番号 5）



1.5 g の 4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノンに、1.5 g のヒドラジン-水和物、及び濃硫酸 1 滴を加え、8 時間加熱還流した。反応終了後、過剰のヒドラジン-水和物を減圧留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより分離精製して、目的物である白色結晶の 4'-クロロ-2,2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン ヒドラゾン 0.8 g を得た。mp 137-139℃

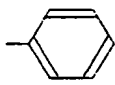
実施例 3 : 4'-クロロ-2, 2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン N
'-{(1-ジメチルアミノ)エチリデン}ヒドラゾン(化合物番号 14)



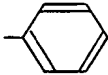
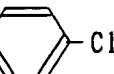
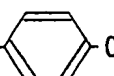
0.9 g の 4'-クロロ-2, 2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン
ヒドラゾンに、0.53 g の N, N-ジメチルアセトアミジン ジメチルアセタ
ールを加え、120℃で2時間反応させた。反応終了後、混合物を室温にまで冷
却し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより分離精製して、目的物である
白色結晶の 4'-クロロ-2, 2-ジメチル-2-フェニルアセトフェノン N
'-{(1-ジメチルアミノ)エチリデン}ヒドラゾン 1.0 g を得た。mp
122-125℃

上記実施例を含め本発明化合物の代表例を第 1 表に示す。

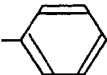

第 1 表

化合物番号	構造式							物理恒数
	X	NR ₁ R ₂	R ₃	R ₄	A	n	Y	
1	4-Cl	NHCO ₂ Et	H	Me	—	0		$N_D^{23.7} 1.5665$
2	4-OSO ₂ Me	"	"	"	"	"	"	$N_D^{22.9} 1.5695$
3	4-Cl	"	"	^t Pr	"	"	"	$N_D^{23.1} 1.5474$
4	"	"	Me	Me	"	"	"	mp 123-124 °C
5	"	NH ₂	"	"	"	"	"	mp 137-139 °C
6	"	NHMe	"	"	"	"	"	
7	"	NMe ₂	"	"	"	"	"	
8	"	NCO ₂ Et Me	"	"	"	"	"	
9	"	NHCOMe	"	"	"	"	"	

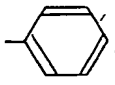
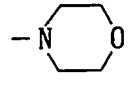
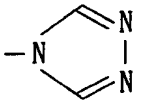
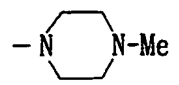
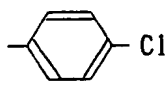
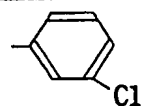
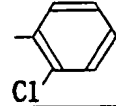
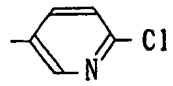
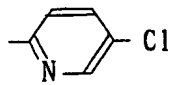
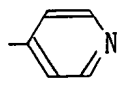
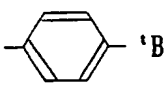
第 1 表 (続き)

10	4-Cl	NHCONHMe	Me	Me	—	0		
11	"	NHCO- 	"	"	"	"	"	
12	"	NHCONH- 	"	"	"	"	"	mp 161-167 °C
13	"	$\begin{array}{c} \text{N}=\text{C}-\text{NHMe} \\ \\ \text{Me} \end{array}$	"	"	"	"	"	
14	"	$\begin{array}{c} \text{N}=\text{C}-\text{NMe}_2 \\ \\ \text{Me} \end{array}$	"	"	"	"	"	mp 122-125 °C
15	"	NHCO ₂ Et	"	Et	"	"	"	mp 123-125 °C
16	"	"	"	CF ₃	"	"	"	
17	"	"	"	ⁱ Pr	"	"	"	
18	"	"	"	allyl	"	"	"	mp 118-120 °C
19	"	"	"	CH ₂ C≡CH	"	"	"	
20	2-Cl	"	"	Me	"	"	"	
21	3-Cl	"	"	"	"	"	"	

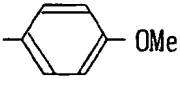
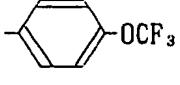
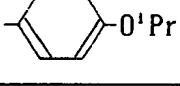
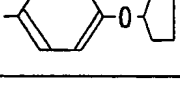
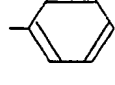
第 1 表 (続き)

22	4-Me	NHCO ₂ Et	Me	Me	—	0		
23	4-CF ₃	"	"	"	"	"	"	
24	4- ^t Bu	"	"	"	"	"	"	mp 114-116 °C
25	4-OMe	"	"	"	"	"	"	N _D ^{22.3} 1.5578
26	4-OCF ₃	"	"	"	"	"	"	
27	4-O ⁱ Pr	"	"	"	"	"	"	mp 88-89 °C
28	4-O 	"	"	"	"	"	"	
29	4-F	"	"	"	"	"	"	
30	4-Br	"	"	"	"	"	"	
31	4-SMe	"	"	"	"	"	"	mp 99-101 °C
32	4-SO ₂ Me	"	"	"	"	"	"	mp 139-140 °C
33	4-OSO ₂ Me	"	"	"	"	"	"	

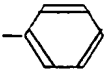
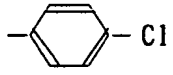
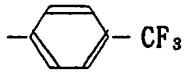
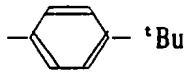
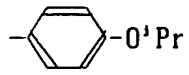
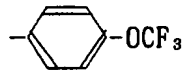
第 1 表 (続き)

34	4-OSO ₂ CF ₃	NHCO ₂ Et	Me	Me	-	0		
35	4-Cl		"	"	"	"	"	N _D ^{24.0} 1.5561
36	"		"	"	"	"	"	N _D ^{25.0} 1.5750
37	4-Cl		"	"	"	"	"	N _D ^{24.0} 1.5571
38	"	NHCO ₂ Et	"	"	"	"	"	
39	"	"	"	"	"	"		mp 121-125 °C
40	"	"	"	"	"	"		mp 133-135 °C
41	"	"	"	"	"	"		
42	"	"	"	"	"	"		mp 90-91 °C
43	"	"	"	"	"	"		
44	"	"	"	"	"	"		
45	"	"	"	"	"	"		mp 121-123 °C

第 1 表 (続き)

46	4-Cl	NHCO ₂ Et	Me	Me	—	0		
47	"	"	"	"	"	"		
48	"	"	"	"	"	"		
49	"	"	"	"	"	"		
50	"	"	"	"	CH ₂	1		
51	"	"	"	"	$\begin{array}{c} \text{C} \\ \\ \text{O} \end{array}$	"	"	
52	"	"	"	"	O	"	"	mp 106-108 °C
53	"	"	"	"	S	"	"	mp 100-103 °C
54	"	"	"	"	$\begin{array}{c} \text{N} \\ \\ \text{H} \end{array}$	"	"	
55	"	"	"	"	$\begin{array}{c} \text{N} \\ \\ \text{Me} \end{array}$	"	"	
56	"	"	"	"	$\begin{array}{c} \text{N} \\ \\ \text{iPr} \end{array}$	"	"	
57	"	$\begin{array}{c} \text{N}=\text{C}-\text{NMe}_2 \\ \\ \text{Me} \end{array}$	"	Et	—	0	"	

第 1 表 (続き)

58	4-Cl	$\begin{array}{c} \text{N}=\text{C}-\text{NMe}_2 \\ \\ \text{Me} \end{array}$	Me	ⁱ Pr	—	0		
59	"	"	"	allyl	"	"	"	
60	4-OSO ₂ Me	"	"	Me	"	"	"	
61	4-CF ₃	"	"	"	"	"	"	
62	4-OCF ₃	"	"	"	"	"	"	
63	4-SO ₂ Me	"	"	"	"	"	"	
64	4- ^t Bu	"	"	"	"	"	"	
65	4-O ⁱ Pr	"	"	"	"	"	"	
66	4-Cl	"	"	"	"	"		
67	"	"	"	"	"	"		
68	"	"	"	"	"	"		
69	"	"	"	"	"	"		
70	"	"	"	"	"	"		

本発明化合物は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロッパアンコンボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、鞘翅目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アゾキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、総翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、直翅目害虫、例えば、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ、トノサマバッタ等、等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレビパルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、植物寄生性線虫類、例えば、サツマイ

モネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシシガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫にも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤、抵抗性系統の害虫にも優れた殺虫効果を有する薬剤である。

本発明の有害生物防除剤は、一般式〔I〕で表わされる化合物またはその塩を有効成分として含有するものであり、有効成分化合物の純品のままでも使用できるが、通常、一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、水溶剤、粉剤、乳剤、粒剤、フロアブル等の形態で使用される。添加剤及び担体としては、固型剤を目的とする場合は、大豆粉、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石膏、タルク、ベントナイト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機および無機化合物が使用される。

液体の剤型を目的とする場合は、植物油、鉱物油、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において、均一なかつ安定な形態をとるために必要ならば界面活性剤を添加することもできる。このようにして得られた水和剤、乳剤、水溶液、フロアブル剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤、粒剤はそのまま、植物に散布する方法で使用する。

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることはいうまでもないが、各種の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤および共力剤と混合して使用することもできる。

本発明化合物と混合して使用できる殺虫剤、殺ダニ剤などの代表例を以下に示す。

有機リンおよびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

ピレスロイド系殺虫剤：

ペルメトリン、シペルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トロラメトリン、シラフルオフエン、プロフェンプロクス、アクリナスリン等。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPP

S、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジェノクロル等。

殺菌剤：

チオファネートメチル、ベノミル、カルベンダゾール、チアベンダゾール、フォルペット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、ポリカーボネート、IBP、EDDP、フサライド、プロベナゾール、イソプロチオラン、TPN、キャプタン、ポリオキシシン、ブラストサイジンS、カスガマイシン、ストレプトマイシン、バリダマイシン、トリシクラゾール、ピロキロン、フェナジンオキシド、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、イプロジオン、ヒメキサゾール、メタラキシル、トリフルミゾール、トリホリン、トリアジメホン、ビテルタノール、フェナリモル、プロピコナゾール、シモキサニル、プロクロラズ、ペフラゾエート、ヘキサコナゾール、ミクロブタニル、ジクロメジン、テクロフタラム、プロピネブ、ジチアノン、ホセチル、ピンクロゾリン、プロシミドン、オキサジキシル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、フルアジナム、オキシソリニック酸、ヒドロキシイソキサゾール等。

次に製剤の実施例を示すが、添加する担体、界面活性剤等はこれらの実施例に限定されるものではない。

実施例 4 乳剤

本発明化合物	20部
アルキルフェニルポリオキシエチレン	5部
ジメチルホルムアミド	40部
キシレン	35部

以上を混合溶解し、使用に際し水で希釈して乳濁液として散布する。

実施例 5 水和剤

本発明化合物	20部
--------	-----

高級アルコール硫酸エステル	5 部
珪藻土	7 0 部
シリカ	5 部

以上を混合して微粉に粉碎し、使用に際し水で希釈して懸濁液として散布する。

実施例 6 粉剤

本発明化合物	5 部
タルク	9 4 . 7 部
シリカ	0 . 3 部

以上を混合粉碎し、使用に際してはそのまま散布する。

実施例 7 粒剤

本発明化合物	5 部
クレー	7 3 部
ベントナイト	2 0 部
ジオクチルスルホサキシネート	
ナトリウム塩	1 部
リン酸ナトリウム	1 部

以上を造粒し、使用に際してはそのまま施用する。

産業上の利用可能性：

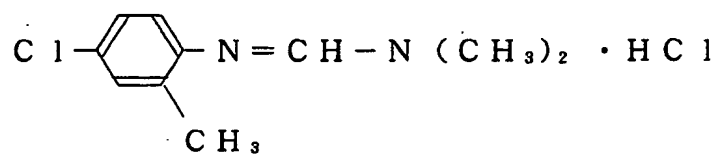
試験例 1 アワヨトウに対する効力

前記薬剤の実施例 5 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希釈した。その薬液中にトウモロコシ葉を 3 0 秒間浸漬し、風乾後、アワヨトウ 3 令幼虫が 5 頭入っているシャーレにその葉を入れた。ガラス蓋をして温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、5 日後に殺虫率を調べた。2 反復である。結果を第 2 表に示した。

第 2 表

化合物番号	5 日後殺虫率 (%)
3	1 0 0
1 4	1 0 0
2 4	1 0 0
2 5	1 0 0
2 7	1 0 0
3 9	1 0 0
対照化合物 A *	4 0

* 対照化合物 A



(クロルジメホルム)

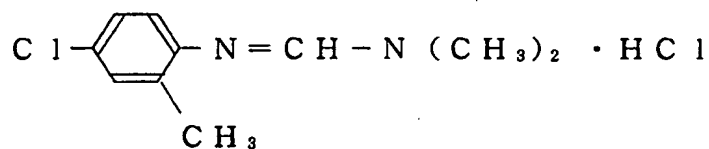
試験例 2 ナミハダニに対する効力

2 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ～ 1 0 日を経過した第 1 本葉上に、有機
 燐剤抵抗性のナミハダニの雌成虫を 1 7 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 5 に
 示された水和剤の処方に従がい、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希
 釈した薬液を散布した。温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、散布 4 日後
 に、殺成虫率を調査した。結果を第 3 表に示した。

第 3 表

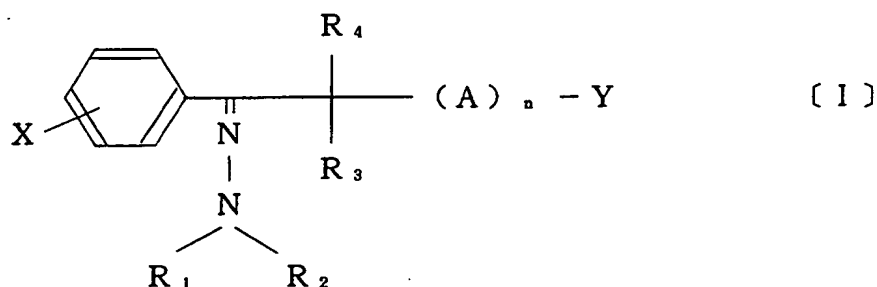
化合物番号	4 日後殺虫率 (%)
1	1 0 0
2	1 0 0
3	1 0 0
4	1 0 0
5	1 0 0
1 5	1 0 0
2 4	1 0 0
2 5	1 0 0
2 7	1 0 0
4 5	1 0 0
対照化合物 A *	5 5

* 対照化合物 A



請 求 の 範 囲

1. 一般式〔I〕



〔式中、Xはハロゲン原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいシクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいアルキルスルフォニルオキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基または置換されていてもよいアルキルスルフォニル基を表し、

R₁ は水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表し、

R₂ は水素原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルキルカルボニル基、置換されていてもよいアルキルカルバモイル基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニルカルボニル基または置換されていてもよいフェニルカルバモイル基を表し、

またR₁ とR₂ が一緒になって、=C(r₁)N r₂ r₃ (式中、r₁、r₂、r₃ は同一または相異なって水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表す。)を形成してもよく、

さらに、NR₁ R₂ が一緒になって置換されていてもよいNを含む5～7員環の複素環基を形成してもよく(但しR₁ R₂ はさらに1～2個の窒素原子または酸素原子を含んでもよい)、

R₃ は水素原子または置換されていてもよいアルキル基を表し、

R₄ は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基または置換されていてもよいアルキニル基を表し、

Aは硫黄原子、酸素原子、置換されていてもよいアルキレン、置換されていてもよいアルキリデン、カルボニルまたはN r₄ (式中、r₄ は水素原子または置

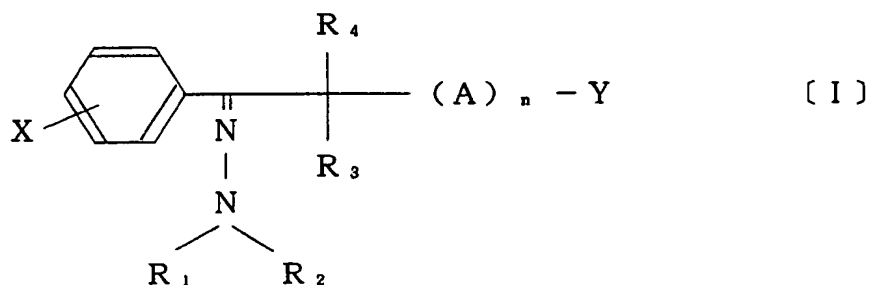
換されていてもよいアルキルを表す。)を表し、

n は 0 または 1 を表し、

Y は置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいピリジル基を表す。]

で表される化合物またはその塩。

2. 一般式 [I]



[式中、X、R₁、R₂、R₃、R₄、A、n および Y は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物またはその塩の 1 種または 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP93/01648

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁵ C07C251/86, C07C323/48, C07C317/32, C07C309/65,
C07C251/88, C07C281/04, C07C281/10, C07D213/42,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁵ C07C251/86, C07C323/48, C07C317/32, C07C309/65,
C07C251/88, C07C281/04, C07C281/10, C07D213/42,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP, A2, 500111 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.), August 26, 1992 (26. 08. 92), Claims & AU, A, 9210888 & CA, A, 2061214 & BR, A, 9200586 & HU, A, T60595 & NZ, A, 241574	1, 2
A	JP, A, 63-93761 (Shering AG.), April 25, 1988 (25. 04. 88), Claim & EP, A1, 254461 & AU, A, 8775730 & FI, A, 8703002 & HU, A, T44401 & BR, A, 8703724 & US, A, 4983755	1, 2
A	JP, A, 56-128746 (Ricoh Co., Ltd.), October 8, 1981 (08. 10. 81), Claim, (Family: none)	1

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

January 12, 1994 (12. 01. 94)

Date of mailing of the international search report

February 8, 1994 (08. 02. 94)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP93/01648

A(Continuation). CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D213/61, C07D295/22, C07D249/14, A01N33/26, A01N47/24

B(Continuation). FIELDS SEARCHED

C07D213/61, C07D295/22, C07D249/14, A01N33/26, A01N47/24

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.³ C07C251/86, C07C323/48, C07C317/32,
C07C309/65, C07C251/88, C07C281/04.

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.³ C07C251/86, C07C323/48, C07C317/32,
C07C309/65, C07C251/88, C07C281/04.

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	EP, A2, 500111 (ISHIHARA SANGYO KAI SHA, LTD.), 26. 8月, 1992 (26. 08. 92). Claims & AU, A, 9210888 & CA, A, 2061214 & BR, A, 9200586 & HU, A, T60595 & NZ, A, 241574	1, 2
A	JP, A, 63-93761 (シェーリング・アクチエンゲゼルシャフト), 25. 4月, 1988 (25. 04. 88).	1, 2

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日
若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献
(理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日
の後に公表された文献

- 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と
矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため
に引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規
性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文
献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性
がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

12. 01. 94

国際調査報告の発送日

08.02.94

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

今村 玲英子

4 H 9 1 6 0

電話番号 03-3581-1101 内線

3444

A. 発明の属する分野の分類

C07C281/10, C07D213/42, C07D213/61,
C07D295/22, C07D249/14, A01N33/26,
A01N47/24

B. 調査を行った分野

C07C281/10, C07D213/42, C07D213/61,
C07D295/22, C07D249/14, A01N33/26,
A01N47/24

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	<p>特許請求の範囲 & EP, A1, 254461 & AU, A, 8775730 & FI, A, 8703002 & HU, A, T44401 & BR, A, 8703724 & US, A, 4983755</p> <p>JP, A, 56-128746 (株式会社 リコー), 8. 10月. 1981 (08. 10. 81), 特許請求の範囲 (ファミリーなし)</p>	1

BEST AVAILABLE COPY